

特開平11-12111

(43) 公開日 平成11年(1999) 1月19日

(51) Int.Cl. <sup>5</sup>	識別記号	F I	
A 0 1 N 47/36	1 0 1	A 0 1 N 47/36	1 0 1 E
43/10		43/10	A
43/76		43/76	
// A 0 1 N 37/22		37/22	
47/34		47/34	E
審査請求 未請求 請求項の数 4 F D (全 11 頁)			
(21) 出願番号	特願平10-176560	(71) 出願人	390023674
(22) 出願日	平成10年(1998) 6月10日		イー・アイ・デュボン・ドウ・ヌムール・ アンド・カンパニー E. I. DU PONT DE NEMO URS AND COMPANY アメリカ合衆国、デラウエア州、ウィルミ ントン、マーケット・ストリート 1007
(31) 優先権主張番号	6 0 / 0 4 9 4 0 7	(72) 発明者	ジーン・アレン・ボザース アメリカ合衆国デラウエア州19707ホツケ シン・ナタリードライブ15
(32) 優先日	1997年6月12日	(74) 代理人	弁理士 小田島 平吉 (外1名)
(33) 優先権主張国	米国 (US)		

(54) 【発明の名称】 除草剤混合物

(57) 【要約】

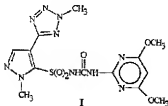
【課題】 雑草に対する相乗作用を有する除草剤混合物を提供すること。

【解決手段】 本発明はアジムスルフロン(azimsulfuron)並びにテニルクロル(thenylchlor)およびペントキサゾン(pentoxazone) から選択される1種もしくはそれ以上の除草剤を含んでなる除草剤混合物、該混合物の除草剤組成物、並びに望ましくない植物を抑制するための該混合物の使用に関する。

## 【特許請求の範囲】

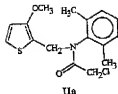
【請求項1】 N-[(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジニル)アミノ]カルボニル]-1-メチル-4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-1H-ピラゾール-5-スルホンアミド (アジムスルホン(azimsulfuron)) である式I

【化1】



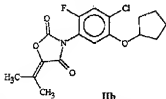
の化合物またはその農業用に適する塩、並びに2-クロロ-N-(2,6-ジメチルフェニル)-N-[(3-メトキシ-2-チエニル)メチル]アセトアミド (テニルクロル(thenylchlor)) である式IIa

【化2】



の化合物および3-[4-クロロ-5-(シクロペンチロキシ)-2-フルオロフェニル]-5-(1-メチルエチリデン)-2,4-オキサゾリジジオン (ペントキサゾン(pentoxazone)) である式IIb

【化3】



の化合物から選択される1種もしくはそれ以上の化合物を含んでなる除草剤混合物。

【請求項2】 ベンスルフロメチル(bensulfuron methyl)、メトスルフロメチル(metsulfuron methyl)、プロパニル(propanil)、クロリムロンエチル(chlorimuron ethyl)、ピラゾスルフロエチル(pyrazosulfuron ethyl)、イマズスルフロン(imazosulfuron)、シノスルフロン(cinosulfuron)およびシクロスルファミロン(cyclosulfamuron)よりなる群から選択される化合物をさらに含んでなる請求項1に記載の除草剤混合物。

【請求項3】 有効量の請求項1に記載の除草剤混合物および少なくとも1種の次の成分：界面活性剤、固体または液体の希釈剤を含んでなる望ましくない植生の成長を抑制するための農業用に適する組成物。

【請求項4】 保護しようとする場所を除草有効量の請求項1に記載の除草剤混合物を接触させることを含んでなる望ましくない植生の成長を抑制するための方法。

## 【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の分野】 本発明は雑草に対する相乗効果を有する除草剤の混合物に関する。

【0002】

【発明の背景】 望ましくない植生(vegetation)の抑制は高い作物効率を得る際に非常に重要である。特に例えばとりわけ、大豆、サトウダイコン、トウモロコシ、ポテト、小麦、大麦、トマトおよびプランテーション作物の如き有用な作物中における雑草の成長の選択的抑制の達成は非常に望ましい。そのような有用な作物中における抑制されない雑草成長は生産性における相当な減少を引き起こし、そしてそれにより消費者に対する価格の増加をもたらす。非作物領域における望ましくない植生の抑制も重要である。そのような成果を達成する生成物を発見するという要望は依然として商業的に重要である。

【0003】 典型的には除草剤の組み合わせを使用すると、植物抑制範囲を拡大または加算の効果による特定種類の抑制水準が高まる。ある種の稀な組み合わせが驚くべきことに加算の効果より大きい効果すなわち相乗効果を与える。そのような価値ある組み合わせが今回発見された。

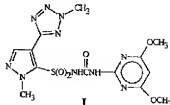
【0004】 米国特許第4,746,353号、米国特許第4,802,907号およびヨーロッパ特許出願公開496,347-A2は、本発明の混合物中で使用される個々の化合物を開示しているが、これらの文献のいずれにも混合物またはそれらの驚くべき相乗的効用は開示されていない。

【0005】

【発明の要旨】 本発明は、雑草を相乗的に抑制することが今回発見された、N-[(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジニル)アミノ]カルボニル]-1-メチル-4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-1H-ピラゾール-5-スルホンアミド (アジムスルホン(azimsulfuron)、式I)

【0006】

【化4】

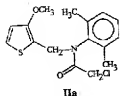


【0007】 またはその農業用に適する塩と、2-クロロ-N-(2,6-ジメチルフェニル)-N-[(3-メト

キシ-2-チエニル)メチル]アセトアミド (テニルクロ  
ル(thenylchlor), 式IIa)

【0008】

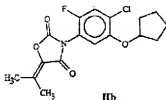
【化5】



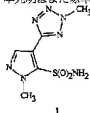
【0009】 および 3-[4-クロロ-5-(シクロペン  
チルオキシ)-2-フルオロフェニル]-5-(1-メチ  
ルエチリデン)-2,4-オキサゾリジンジオン (ペント  
キサゾン(pentoxazone), 式IIb)

【0010】

【化6】



【0011】 から選択される1種もしくはそれ以上の化  
合物の混合物に関する。本発明はまた除草有効量の上記\*



1

【0017】 本発明の混合物は式Iのスルホニルウレア  
化合物を1種もしくはそれ以上のその農業用に適する塩  
として含むことができる。これらは当該技術分野で既知  
である多くの方法で製造することができる。例えば、式  
Iのスルホニルウレアを十分な塩基性アニオンを有する  
アルカリまたはアルカリ土類金属塩 (例えば、水酸化  
物、アルコキシド、炭酸塩または水素化物) の溶液と接  
触させることにより金属塩を製造することができる。第  
四級アミン塩は同様な技術により製造することができ  
る。

【0018】 式Iのスルホニルウレアの塩はまた1つの  
カチオンと別のものととの交換によっても製造することが  
できる。カチオン交換は式Iのスルホニルウレアの塩  
(例えば、アルカリまたは第四級アミン塩) の水溶液と  
交換しようとするカチオンを含有する溶液との直接的接  
触により行うことができる。この方法は交換されたカチ

\*の混合物および少なくとも1種の次の成分: 界面活性  
剤、固体または液体の希釈剤を含んでなる除草剤組成物  
にも関する。本発明はまた望ましくない雑生の場所に除  
草有効量の上記の混合物を適用することを含んでなる望  
ましくない雑生を抑制する方法にも関する。

【0012】 増強された除草利用にとって好適な本発明  
の混合物には、(a) 式Iの化合物および式IIaの化合  
物、並びに (b) 式Iの化合物および式IIbの化合物が  
包含される。除草有効量の該好適な混合物および少なく  
とも1種の次の成分: 界面活性剤、固体または液体希釈  
剤を含んでなる除草剤組成物も好適である。

【0013】 望ましくない雑生を抑制する好適な方法  
は、雑生の場所に除草有効量の好適な混合物またはそれ  
らの組成物を適用することを含んでなる。

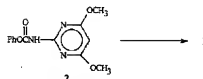
【0014】 雑草抑制範囲および/または作物選択性の  
理由のために、本発明の混合物の好適な適用はイネ作物  
中、特に水田イネ栽培中である。

【0015】 発明の詳細

式Iの化合物は米国特許第4,746,353号に記載さ  
れている。その合成は式1のピラゾールスルホニルアミド  
と式2の複素環式カルバメートのカップリングを包含す  
る。

【0016】

【化7】



2

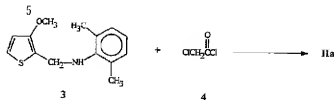
オンを含有する所望する塩が水中に不溶性でありそして  
濾過により分離できる時に最も有効である。

【0019】 式Iのスルホニルウレアの塩 (例えば、アル  
カリまたは第四級アミン塩) の水溶液を元の塩のカチ  
オンと交換すべきカチオンを含有するカチオン-交換樹脂  
が充填されたカラムに通ずることにより交換を行って  
もよくそして所望する生成物をカラムから溶離する。こ  
の方法は所望する塩が水溶性である時 (例えば、カリウ  
ム、ナトリウムまたはカルシウム塩) に特に有用であ  
る。

【0020】 式IIaの化合物は米国特許第4,802,9  
07号に記載されている通りにして製造することができ  
る。この合成は式3のアニンと式4のアシルクロリド  
とのカップリングを包含する。

【0021】

【化8】

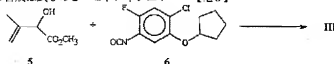


【0022】式IIbの化合物はヨーロッパ特許出願公開  
496,347-A2に記載されている通りにして製造  
することができる。その合成は式5の2-ヒドロキシエチル

\*ステルと式6のイソシアナートとの環化を包含する。

【0023】

【化9】



#### 【0024】混合

式I並びに式IIaおよびIIbの化合物の混合物は多くの  
方法で調合することができる：

(a) 式I並びに式IIaおよびIIbの化合物を別個に調  
合しそして別個に適用することができ、または適当な重  
量比で例えばタンク混合物として同時に適用することが  
でき、或いは(b) 式I並びに式IIaおよびIIbの化  
合物を適当な重量比で一緒に調合することができる。

【0025】式I並びに式IIaおよびIIbの化合物の混  
合物は、一般的には液体もしくは固体の希釈剤および/  
または界面活性剤を含んでなる農業用に適用する担体との  
調合物において使用され、そこではその調合物は活性成  
分の物理的性質、適用方式並びに環境要素、例えば土壌  
のタイプ、水分および湿度に適合させる。有用な調合物  
には、場合により濃縮化してゲルにすることができる液  
体、例えば液剤(乳化可能な濃縮物を含む)、懸濁剤、  
乳剤(微細乳剤および/または懸濁乳剤を含む)などが\*

※包含される。有用な調合物にはさらに、水一分散性  
(「湿潤性」)または水溶性でありうる固体、例えば粉  
剤(dust)、散剤(powder)、顆粒剤、ペレット、錠剤、フ  
ィルムなどが包含される。活性成分は(マイクロ)カプ  
セル化しそしてさらに懸濁液または固体調合物に形成さ  
れていてもよく、或いは活性成分の調合物全体をカプセル  
化(または「オーバーコーティング」)することもで  
きる。カプセル化は活性成分の放出を抑制または遅延さ  
せることができる。噴霧可能な調合物を適当な媒体中に  
希釈しそして1ヘクタール当たり約1〜数百リットルの  
噴霧量で使用することができる。高濃度組成物は主とし  
て別の調合物用の中間体として使用される。

【0026】調合物は典型的には有効量の活性成分、希  
釈剤および界面活性剤を合計100重量%になる下記の  
概略範囲内で含有する。

【0027】

	活性成分	重量%	
		希釈剤	表面活性剤
水一分散性および水溶性 顆粒剤、錠剤および散剤	5-90	0-94	1-15
懸濁剤、乳剤、液剤 (濃縮乳剤を含む)	5-50	40-95	0-15
粉剤	1-25	70-99	0-5
顆粒剤および錠剤	0.01-99	5-99.99	0-15
高濃度組成物	90-99	0-10	0-2

代表的な固体希釈剤はWatkins, et al., Handbook of I  
nsecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Do  
rland Books, Caldwell, New Jerseyに記載されてい  
る。代表的な液体希釈剤はMarsden, Solvents Guide, 2  
nd Ed., Interscience, New York, 1950に記載されて  
いる。McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annu  
al, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey、並  
びに Siselyand Wood, Encyclopedia of Surface Activ  
e Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964  
は界面活性剤およびその推奨用途を示している。全て

の調合物は、泡立ち、ケーキ化、腐食、微生物の生長な  
どを減ずるためにまたは濃縮化して粘度を増すために少  
量の添加剤を含有することができる。

【0028】界面活性剤には、例えば、ポリエトキシ  
化アルコール類、ポリエトキシ化アルキルフェノール  
類、ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル類、ジ  
アルキルスルホ琥珀酸類、硫酸アルキル類、スルホン酸  
アルキルベンゼン類、有機シリコーン類、N,N-ジアル  
キルタウレート類、リグニンスルホン酸塩類、ナフト  
レンスルホネートホルムアルデヒド縮合物、ポリカルボ

キシレート類、およびポリエチレン/ポリオキシプロピレンブロック共重合体が包含される。固体希釈剤には、例えば、クレー、例えばベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリン、澱粉、砂糖、シリカ、タルク、珪藻土、ウレア、炭酸カルシウム、炭酸および炭酸水素ナトリウム、並びに硫酸ナトリウムが包含される。液体希釈剤には、例えば、水、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N-アルキルピロリドン、エチレングリコール、ポリプロピレングリコール、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、オリーブ油、ヒマシ油、アマニ油、桐油、ゴマ油、トウモロコシ油、ピーナツ油、綿実油、大豆油、菜種油およびヤシ油、脂肪酸エステル類、ケトン類、例えばシクロヘキサノン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノン、並びにアルコール類、例えばメタノール、シクロヘキサノール、デカノールおよびデトラヒドロフルリルアルコールが包含される。

【0029】濃厚乳剤を包含する液剤は、成分を単に混合することにより製造することができる。化学的に安定化された水性スルホニルウレアまたは農業用に適するスルホニルウレア塩分散液は米国特許第4,936,900号に教示されている。改良された化学的安定性を有するスルホニルウレアの液剤調合物は米国特許第4,599,412号に教示されている。粉剤および散剤は、配合しそして一般的にはハンマミルまたは流体力エネルギーミル中のように粉碎することにより製造できる。懸濁剤は一般的には湿潤-粉碎により製造され、例えば、米国特許第3,060,084号を参照のこと。顆粒剤およびペレットは活性物質を予備成形された粒状担体に噴霧することによりまたは凝集技術により製造することができる\*

#### 実施例A

##### 高強度濃原剤

アジメスルフロン(azimsulfuron)	1.0%
テニクロル(thenylchlor)	97.5%
シリカエーロゲル	0.5%
合成非晶質微細シリカ	1.0%

#### 実施例B

##### 水和剤

アジメスルフロン(azimsulfuron)	21.7%
テニクロル(thenylchlor)	43.3%
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%
シリコアルミン酸ナトリウム	6.0%
モンモリロナイト (か焼されたもの)	23.0%

#### 実施例C

##### 顆粒剤

アジメスルフロン(azimsulfuron)	1.7%
テニクロル(thenylchlor)	8.3%
アタパルジャイト顆粒 (低揮発性物体、0.71/0.30 mm、	

する。Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-148, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 以下、並びにWO 91/13546を参照のこと。ペレットは米国特許第4,172,714号に記載されている通りにして製造することができる。水一分散性および水溶性顆粒剤は米国特許第4,144,050号、米国特許第3,920,442号およびDE 3,246,493号に教示されている通りにして製造することができる。錠剤は米国特許第5,180,587号、米国特許第5,232,701号および米国特許第5,208,030号に教示されている通りにして製造することができる。フィルムは英国特許第2,095,558号および米国特許第3,299,566号に教示されている通りにして製造することができる。

【0030】調合技術に関する別の情報に關しては、米国特許第3,235,361号、6欄、16行〜7欄、19行および実施例10-41；米国特許第3,309,192号、5欄、43行〜7欄、62行および実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167および169-182；米国特許第2,891,855号、3欄、66行〜5欄、17行および実施例1-4；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96；並びに Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989を参照のこと。

【0031】以下の実施例では、百分率はすべて重量によるものであり、そして調合物はすべて一般的方法で製造される。

#### 【0032】

U.S.S.No.25-50ふるい 90.0%

実施例D押し出し成形されたベレット

アジムスルフロン(azimsulfuron)	0.6%
テニルクロル(thenylchlor)	24.4%
無水硫酸ナトリウム	10.0%
粗製リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%

実施例E高強度濃厚剤

アジムスルフロン(azimsulfuron)	0.7%
ベントキサゾン(pentoxazone)	97.8%
シリカエーロゲル	0.5%
合成非晶質微細シリカ	1.0%

実施例F水和剤

アジムスルフロン(azimsulfuron)	21.7%
ベントキサゾン(pentoxazone)	43.3%
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%
シリコアルミン酸ナトリウム	6.0%
モンモリロナイト(か焼された)	23.0%

実施例G顆粒剤

アジムスルフロン(azimsulfuron)	0.9%
ベントキサゾン(pentoxazone)	9.1%
アタパルジャイト顆粒(低揮発性物体、0.71/0.30mm、	
U.S.S.No.25-50ふるい)	90.0%

実施例H押し出し成形された押し込み錠

アジムスルフロン(azimsulfuron)	0.5%
ベントキサゾン(pentoxazone)	24.5%
無水硫酸ナトリウム	10.0%
粗製リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%

実施例I高強度濃厚剤

アジムスルフロン(azimsulfuron)	6.2%
テニルクロル(thenylchlor)	36.9%
ベントキサゾン(pentoxazone)	55.4%
シリカエーロゲル	0.5%
合成非晶質微細シリカ	1.0%

用途

式I並びに式II aおよびII bの除草性化合物の混合物が、例えばイネの如きある種の一年生単子葉植物種に対する選択的安全性を保有しながら、選択された雑草の予期せぬ恒量的抑制を与えることが今回発見された。本発明の混合物は、移植されたまたは直置きされたジャポニ

カ(japonica)またはインディカ(indica)イネに対する影響をほとんどまたは全く有していないが、望ましくない地上または水性のイネ科植物(grass)、広葉植物、およびスゲ科植物(sedge)の雑草種の成長を選択的に抑制するのに有効である。これらがイネに対する被害なしにイヌビエ(barnyardgrass)の抑制を与える相乗的作用は、

イヌビエおよびイネが両者ともイネ科植物であるため、非常に価値があり且つ注目すべきである。本発明の混合物を雑草種がはびこっている乾燥土または灌水土に適用することにより、或いは雑草植物の葉への適用により、或いは葉、種子または植物部分を覆う水への適用により、雑草は死滅するかまたは十分な被害を受けてイネ作物に対して競争に負けない利点を与える。発芽前から4葉段階までの直置きイネへの適用、1.0-4.0葉段階での移植イネへの適用および発芽前から3葉段階までの雑草に対する適用が好ましい。適用は間欠的にまたは連続的な灌漑式イネ栽培に対して行うことができる。

【0033】式I (アジメスルフロン(azimsulfuron)) および式IIa (テニルクロル(thenylchlor)) の化合物の除草有効量は環境条件、調合、適用方法、存在する植物の量およびタイプなどに依存して変動するであろう。式I対式IIaの使用割合は一般的には1:2~1:100であり、ほとんどの用途には1:5~1:4.0の比が好ましい。一般的には、式Iの化合物は3~300 g a i / h a の割合で適用され、そして式IIaの化合物は50~300 g a i / h a の割合で適用される。好適には、式Iの化合物は5~20 g a i / h a の割合で適用され、そして式IIaの化合物は75~250 g a i / h a の割合で適用される。

【0034】式I (アジメスルフロン(azimsulfuron)) および式IIb (ペンタキサン(pentoxazone)) の化合物の除草有効量は環境条件、調合、適用方法、存在する植物の量およびタイプなどに依存して変動するであろう。式I対式IIbの使用割合は一般的には1:2~1:150であり、ほとんどの用途には1:10~1:50の比が好ましい。一般的には、式Iの化合物は3~30 g a i / h a の割合で適用され、そして式IIbの化合物は50~500 g a i / h a の割合で適用される。好適には、式Iの化合物は5~20 g a i / h a の割合で適用され、そして式IIbの化合物は75~400 g a i / h a の割合で適用される。

【0035】当該技術分野の専門家は、適用割合並びに式Iの除草剤対式IIaおよびIIbの除草剤の比並びに所望とする雑草抑制および作物安全性水準に要する時機を容易に決めることができる。

【0036】除草剤処置としての実際的な使用のために、本発明の混合物をさらに他の既知の除草剤および農業用の作物保護化学薬品と混合して別の雑草種に対する追加的活性範囲を与えるようにしてもよい。混合しうる除草剤には下記のものが含まれるがそれらに限定されない: シハロフブツチアル(cyhalofop-butyl)、カフエントロール(cafenstrol)、ジメビペレート(dimepiperate)、エポバダン(epoprodan)、エトベンザニド(etobenzanid)、プレチラクロル(pretilachlor)、チオベンカルブ(thiobencarb)、ピリバチカルブ(pyributicarb)、ピラゾレート(pyrazolate)、ペンキソフェナチド

(benxofenap)、プロモブチド(bromobutid)、メフェナセツト(mefenacet)、アミノフォス(anilofos)およびベンフレスート(benfuresate)。好適に使用される除草剤混合物相手はスルホニルウレア除草剤であるベンスルフロンメチル(bensulfuron methyl)、メトスルフロニエチル(metsulfuron ethyl)、クロリムロンエチル(chlorimuron ethyl)、ピラゾスルフロニエチル(pyrazosulfuron ethyl)、イマズスルフロニ(inazosulfuron)、シノスルフロニ(cinosulfuron)およびシクロスルファミロン(cyclosulfamuron)である。

【0037】さらに、本発明の混合物を、農業用に許容可能な添加剤、例えば界面活性剤、緩衝剤、展着剤、乳化剤または肥料と組み合わせて性能を改良してもよい。本発明の混合物は一般的には調合された組成物として使用されるであろう。

【0038】下記の試験は特定の雑草に対する本発明の化合物の抑制効果を示す。しかしながら、これらの化合物により得られる雑草抑制はこれらの確に限定されるものではない。これらの試験では、化合物1は式Iの化合物であるアジメスルフロン(azimsulfuron)であり、化合物2は式IIaの化合物であるテニルクロル(thenylchlor)であり、そして化合物3は式IIbの化合物であるペンタキサン(pentoxazone)である。

#### 【0039】本発明の生物学実施例

##### 試験A処方

イヌビエ (Echinochloa crus-galli) の個々の容弱に種を置きそして発生の2葉段階まで成長させた。繁殖のためにタマ・シルト・ローム土(Tama silt loam soil)を使用した。イネ(Oryza sativa, cv. Cypress)を予備発芽させそして土の表面に種を置きそして発生の3葉段階まで成長させた。処置前に全ての容器中の水の深さを約3 cmに調節した。化合物1および2を非-雑毒性溶媒混合物中で調合しそして各容器中の土の表面に適用した。

【0040】処置した植物および未処置対照を温室条件下で14日間保ち、その時点で植物を未処置対照と比較しそして視覚的に評価した。表Aにまとめる植物応答評価は0~100の目盛りに基づいており、そこでは0は効果なしでありそして100は完全抑制である。

【0041】コルビー(Colby)式を使用して化合物1と化合物2の混合物中の混合される加算的除草効果を計算した。コルビー式(Colby, S. R. "Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations," Weeds, 15(1), pp20-22 (1967)) により除草剤混合物の予測される加算的效果を計算し、そして2種の活性成分に拠しては式:

$$P_{AB} = P_A + P_B - (P_A \times P_B / 100)$$

【式中、 $P_{AB}$  は個々の成分の加算的寄与から予測される混合物の効果百分率であり、 $P_A$  は混合物中での同時使用割合における第一活性成分の観察された効果百分率

であり、そしてP.は混合物中での同時使用割合における第二活性成分の観察された効果百分率である]により計算される。

【0042】化合物1と化合物2の組み合わせは、驚くべきことに、コルビー式からの計算により予測されるものより良好なある種の雑草の抑制を与えることが見いだされ、従って相乗的作用を示す。表Aは化合物1および化合物2を単一活性成分として単独で適用した場合、化合物A\*

単独および混合物中での活性成分としての化合物1  
および化合物2の効果

化合物 1	化合物 2	イネ		イヌビエ	
		観 察	予測1	観 察	予測
単 独					
5	0	0	—	30	—
10	0	10	—	70	—
0	90	0	—	70	—
0	180	40	—	98	—
混合物					
5	90	30	0	85	79
10	90	10	10	98	91
5	180	40	40	99	99
10	180	40	46	100	99

\* 適用割合は化合物1および化合物2の両者に関して  $g\ a\ i/h\ a$  で表示されている。データは抑制百分率として報告されている。

† コルビー式から予測されたもの。

【0044】この試験からわかるように、アジメスルフロンのアジンスルフロンの(化合物1)と90 g/h aのテニクロール(thenylchlor) (化合物2)の組み合わせはイヌビエ抑制を予測されたものより驚異的に増加させた。5 gのアジメスルフロンの90 gのテニクロールの場合には、抑制は不良(79%)から良好(85%)に増加した。10 gのアジメスルフロンの90 gのテニクロールの場合には、抑制は91%(良好)の予測値から98%(優秀)となった。より高いテニクロールの割合(180 g/h a)では、抑制はすでに優秀(98%)であったため、この試験ではこの高い割合では相乗的作用を示す機会がなかった。この相乗的作用により、本発明の混合物はコルビー式を使用した個々の成分の効果の加算に基づいて必要であろうものより実質的に低い適用割合で適用することができる。5 gのアジメスルフロンの90 gのテニクロールという低い割合で見られるイネ被害の増加は、10 gのアジメスルフロンのいうより高い割合またはテニクロールのより高い割合において被害の増加が起きていないため、明らかに異常である。この試験

\* 化合物1および化合物2の2種の活性成分の混合物として適用した場合の特定雑草の抑制の視覚的評価、並びに化合物1および化合物2の除草剤混合物の予測される加算的效果(コルビー式)を示す。化合物1対化合物2の種々の比、並びに種々の割合タイプが2種の除草剤の組み合わせにより有用な雑草抑制を与える。

【0043】

【表1】

における直接的に水に種まかれたイネはより一般的な農業用の実施法である移植イネより除草剤による被害に対して敏感である。さらに、イネは屋外より温室内で成長させる時の方がはるかに脆弱であり、そして除草剤による被害に対してより敏感である。これらの温室結果は従って10 g/h aのアジメスルフロンのおよび180 g/h aのテニクロール程度の高い割合では畑条件下では作物の被害がほとんどまたは全くないことを示唆している。

#### 【0045】試験3処方

イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*) の個々の容器に種を敷きそして発生の2葉段階まで成長させた。繁殖のためにタマ・シルト・ローム土を使用した。イネ (*Oryza sativa*, cv. Cypress) を予備発芽させそして土の表面に種を敷きそして発生の3葉段階まで成長させた。処置前に全ての容器中の水の深さを約3 cmに調節した。化合物1および3を非一植物毒性溶媒混合物中で調合しそして各容器中で土の表面に適用した。

【0046】処置した植物および未処置対照を温室条件



下で14日間保ち、その時に植物を未処置対照と比較し  
そして視覚的に評価した。表3にまとめる植物応答評価  
は0~100の目盛りに基づいており、そこでは0は効  
果なしでありそして100は完全抑制である。

【0047】化合物1と化合物3の組み合わせは、驚く  
べきことに、コルビー式からの計算により予測されるも  
のより良好なある種の雑草の抑制を与えることが見だ  
され、従って相乗的作用を示す。表Bは化合物1および  
化合物3を単一活性成分として単独で適用した場合、化\*

表B\*

単独および混合物中の活性成分としての化合物1および  
化合物3の効果

化合物 1	化合物 3	イネ(直撒き)		イヌビエ	
		観 察	予測†	観 察	予測
単 独					
5	0	0	—	30	—
10	0	0	—	70	—
0	75	0	—	60	—
0	150	0	—	90	—
混 合 物					
5	75	0	0	95	72
10	75	0	0	95	88
5	150	0	0	90	93
10	150	0	0	98	97

\* 適用割合は化合物1および化合物3の両者に関して  $g\ a\ l / h\ a$  で  
表示されている。データは抑制百分率として報告されている。

† コルビー式から予測されたもの。

【0049】この試験からわかるように、イヌビエの9  
0%以下の抑制を与えるであろうと予測されたアジス  
スルフロン(aziasulfuron) (化合物1)と75  $g / h\ a$  の  
ペンタキザゾン(pentoxazone) (化合物3)の組み合わ  
せがはるかに良好な効果を与えることが驚くべきこと  
に見いだされた。例えば、5  $g / h\ a$  のアジススルフロ  
ンおよび75  $g / h\ a$  のペンタキザゾンはイヌビエに対  
して72%の被害しか与えないであろうと予測されたが、  
95%が観察された。これは最適および最適以下の抑制  
水準の間にある差である。この相乗的作用により、本発  
明の混合物はコルビー式を使用した個々の成分の効果  
の加算に基づいて必要であろうものより実質的に低い適用  
割合で適用することができる。イヌビエに対する相乗的  
作用とは対照的に、直撒きされたイネには被害が観察さ  
れなかった。

\* 化合物1および化合物3の2種の活性成分の混合物として  
適用した場合の特定雑草の抑制の視覚的評価、並びに化  
合物1および化合物3の除草剤混合物の予測される加算  
的效果(コルビー式)を示す。化合物1対化合物3の種  
々の比、並びに種々の調合タイプが2種の除草剤の組み  
合わせにより有用な雑草抑制を与える。

【0048】

【表2】

#### 【0050】試験C処方

移植イネ (Oryza sativa, cv. Cypress) をタマ・シル  
ト・ローム土中で処置前に5葉段階まで成長させた。イ  
ヌビエ (Echinochloa crus-galli) は2葉段階であ  
った。化学薬品を混合しそして水田に直接加えた。3回反  
復しそして完全に無作為の設定で温室ベンチ上に容器を  
配置した。水の深さを実験中はずっと3 cmに保った。  
処置から14日後に、イネの被害水準およびイヌビエの  
抑制を視覚的評価により測定した。表Cにまとめる植物  
応答評価は0~100の目盛りに基づいており、そこ  
では0は効果なしでありそして100は完全抑制である。  
コルビー式を使用して化合物1と化合物3の混合物の予  
測される加算的除草効果を計算した。

【0051】

【表3】

表C\*

単独および混合物中での活性成分としての化合物1  
および化合物3の効果

化合物 1	化合物 3	イネ(移植)		イヌビエ	
		観察	予測	観察	予測
単 独					
5	0	0	—	37	—
10	0	0	—	73	—
15	0	0	—	88	—
0	50	0	—	0	—
0	100	0	—	33	—
0	150	0	—	40	—
混合物					
5	50	0	0	57	37
5	100	0	0	65	58
5	150	0	0	67	62
10	50	0	0	84	73
10	100	0	0	96	82
10	150	0	0	95	84
15	50	0	0	94	88
15	100	3	0	99	92

\* 適用割合は化合物1および化合物3の両者に関して g a i / h a  
で表示されている。データは抑制百分率として報告されている。

† コルビー式から予測されたもの。

【0052】この試験からわかるように、アジスルフ  
ロン(aziasulfuron) (化合物1) とペントキサゾン(pen  
toxazone) (化合物3) の組み合わせは全ての試験され  
た割合において予測された抑制値より実質的に良好なイ  
ヌビエ抑制効果を与えた。予測された効果が相対的に低  
い時には相乗的作用が最大の効果増加を与えることがで  
きる。この試験では、5 g / h a のアジスルフロンと  
50 g / h a のペントキサゾンは37%の予測値に対し  
て57%の抑制を与えた。予測された効果がすでに10  
0%近い時には、観察された効果はそれよりはるかに大  
きいことはありえないが、この試験では15 g / h a の  
アジスルフロンおよび100 g / h a のペントキサゾ  
ンからの相乗的作用でも92%の予測値から99%の抑  
制という有意の増加を生じた。この相乗的作用により、  
アジスルフロンとペントキサゾンの混合物はより低い  
適用割合において予測値より有意に良好な抑制を与え  
る。イヌビエに対する相乗的作用とは対照的に、移植イ  
ネには被害が実質的に観察されなかった。

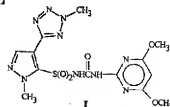
【0053】本発明の主たる特徴および態様は以下のと  
おりである。

【0054】1. N-[(4,6-ジメトキシ-2-ピリ

ミジニル)アミノ]カルボニル]-1-メチル-4-(2-  
メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-1H-ピラ  
ゾール-5-スルホアミド (アジスルフロン(azins  
ulfuron)) である式I

【0055】

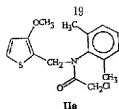
【化10】



【0056】の化合物またはその農業用に適する塩、並  
びに2-クロロ-N-(2,6-ジメチルフェニル)-N-  
-[(3-メトキシ-2-チエニル)メチル]アセトアミド  
(デニルクロール(thenylchlor)) である式II a

【0057】

【化11】

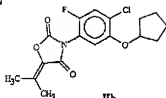


IIa

【0058】の化合物および3-[4-クロロ-5-(シクロペンチルオキシ)-2-フルオロフェニル]-5-(1-メチルエチリデン)-2,4-オキサゾリジンジオン(ペントキサゾン(pentoxazone))である式IIb

【0059】

【化12】



IIb

【0060】の化合物から選択される1種もしくはそれ以上の化合物を含んでなる除草剤混合物。

【0061】2. 式Iの化合物および式IIaの化合物を含んでなる上記1の除草剤混合物。

【0062】3. 式Iの化合物および式IIbの化合物を

含んでなる上記1の除草剤混合物。

【0063】4. ベンスルフロメチル(bensulfuron methyl)、メトスルフロメチル(metsulfuron methyl)、プロパニル(propanil)、クロリムロンエチル(chlorimuron ethyl)、ピラゾスルフロエチル(pyrazosulfuron ethyl)、イマゾスルフロン(imazosulfuron)、シノスルフロン(cinosulfuron)およびシクロスルファミロン(cyclosulfamuron)よりなる群から選択される化合物をさらに含んでなる上記1、2または3のいずれかの除草剤混合物。

【0064】5. 有効量の上記1、2または3のいずれかの除草剤混合物および少なくとも1種の次の成分：界面活性剤、固体または液体の希釈剤を含んでなる望ましくない植生(vegetation)の成長を抑制するための農業用に適する組成物。

【0065】6. 保護しようとする場所に除草有効量の上記1、2または3のいずれかの除草剤混合物を接触させることを含んでなる望ましくない植生の成長を抑制するための方法。

【0066】7. 保護しようとする場所がイネ作物である上記6の方法。

【0067】8. イネ作物が灌水した水田(flooded paddy)の中で成長する上記7の方法。